

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

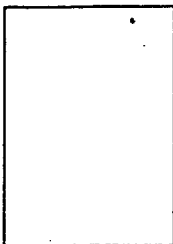
Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problems Mailbox.**



WO9961029A1: SLEEP INDUCING AGENT

[View Images \(24 pages\)](#) | [View Cart](#)

Premium Data ¹: [PDF \(~2280 KB\)](#) | [TIFF \(~1800 KB\)](#) | [Fax](#) | [More choices...](#)

Inventor(s): **TANAMI, Tohru** , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
KAMEO, Kazuya , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
YAMADA, Kenji , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
OKUYAMA, Shigeru , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan
ONO, Naoya , Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takata 3-chome, Toshima-ku, Tokyo 170.ndash, Japan

Applicant(s): **SATO, Fumie**, 2-1-901, Kugenmahigashi, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-0026, Japan

Issued/Filed Dates: **Dec. 2, 1999** / May 25, 1999

Application Number: **WO1999JP0002723**

IPC Class: **A61K 031/557; C07C 405/00;**

Designated Countries: AU, CA, CN, JP, KR, US. **European patent:** AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE

Abstract: A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by (CH₂)_m, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH₂ or S(O)_nCH₂, R₁ is a C3-10 cycloalkyl group, a C3-10 cycloalkyl group substituted with a C1-4 alkyl group, a C4-13 cycloalkylalkyl group, a C5-10 alkyl group, a C5-10 alkenyl group, an C5-10 alkynyl group or a bridged cyclic hydrocarbon group, R₂ represents a hydrogen atom, a C1-10 alkyl group or a C3-10 cycloalkyl, m is an integer of 1 to 3, and n is 0, 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt or hydrate thereof.

[\[Show "fr" Abstract\]](#)

Representative image:

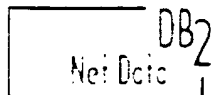
[View Images](#)

[\[Show "fr" image\]](#)

Attorney, Agent, or Firm: **KITAGAWA, Tomizo:**

Foreign References: **none**

(No patents reference this one)



Alternate Searches



[Patent Number](#)



[Boolean Text](#)



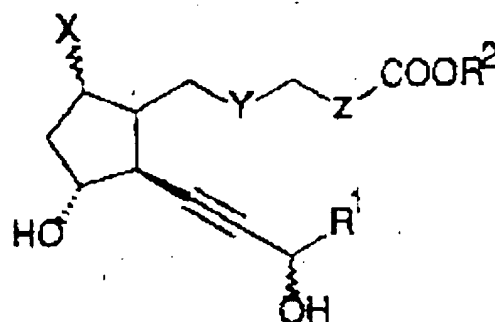
[Advanced Text](#)

Nominate this invention

PatentManna SEARCH-PATENT FULL TEXT

(57)要約

式



(式中、Xはハロゲン原子を示し、Yは $(CH_2)_m$ で表シスビニレン基又はフェニレン基を示し、Zはエチレン、スビニレン基、 OCH_2 又は $S(O)_2CH_2$ を示し、 R^1 シクロアルキル基、 C_{1-10} のアルキル基で置換された C_{1-10} アルキル基、 C_{1-10} のシクロアルキルアルキル基、 C_{1-10} アル基、 C_{3-10} のアルケニル基、 C_{3-10} のアルキニル基又炭化水素基を示し、 R^2 は水素原子、 C_{1-10} のアルキル基のシクロアルキル基を示し、mは1～3の整数を示し、又は2を示す。)

で表されるプロスタグランジン誘導体又はその薬理的な塩および水和物を有効成分とする睡眠誘発剤。

PCTに基づいて公開される国際出願のパブリック第一頁に掲載されたPCT加盟国を特定するために使

AE アラブ首長国連邦
AL アルバニア
AM アルメニア
AN アンゴラ
AO オーストラリア
AU オーストラリア

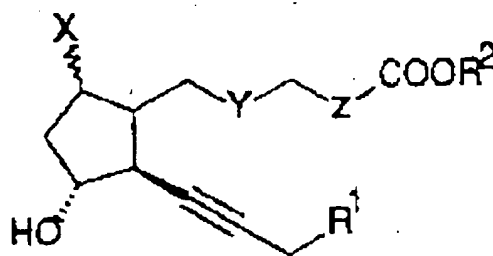
DM ドミニカ
EE エストニア
ES スペイン
FI フィンランド
FR フランス

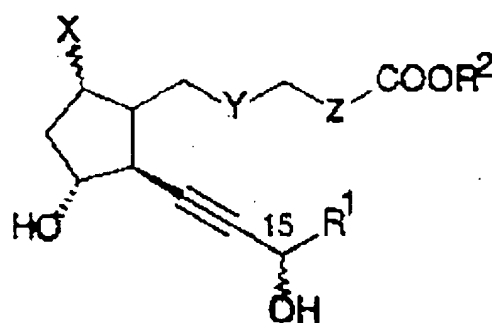
KZ カザフスタン
LC セントルシア
LI リヒテンシュタイン
LK スリランカ
LR リベリア

RU
SI
SI
SK
S

(57)要約

式

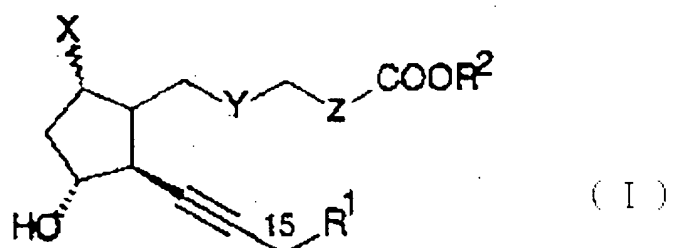


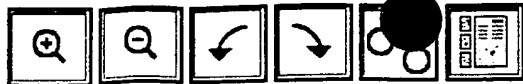


(I)

表 1

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 1	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物 2	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 3	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 4	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 5	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 6	α -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 7	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 8	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 9	F	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 10	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 11	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 12	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 13	β -Br	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 14	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物 15	β -Cl	CH=CH	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 16	β -Cl	CH=CH	OCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル





世界知的所有権機関

国際事務局

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 A61K 31/557, C07C 405/00	A1	(11) 国際公開番号 (43) 国際公開日 1999年5月25日(25.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/02723	(72) 発明者：および (75) 発明者／出願人（米国についての 田名見亨(TANAMI, Tetsuo)[JP/JP] 亀尾 一彰(KAMEO, Kazuya)[JP/JP] 山田 悠司(YAMADA, Kenji)[JP/JP] 奥山 茂(OKUYAMA, Shigeru)[JP/JP] 小野直哉(ONO, Naoya)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社内 Tokyo, (JP)	(74) 代理人 弁理士 北川富造(KITAGAWA, Tomizo) 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番 大正製薬株式会社 特許部 Tokyo, (JP)
(22) 国際出願日 1999年5月25日(25.05.99)	(71) 出願人（米国を好むすべての指定国について） 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP] 〒170-8633 東京都豊島区高田3丁目24番1号 Tokyo, (JP)	(81) 指定国 AU, CA, CN, JP, KR, US, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, JP
(30) 優先権データ 特願平10/142622 1998年5月25日(25.05.98)	(71) 出願人：および (72) 発明者 佐藤史尚(SATO, Fumio)[JP/JP] 〒251-0026 神奈川県藤沢市鵠沼東2-1-901 Kanagawa, (JP)	部付公開書類 国際調査報告書

(54)Title: SLEEP INDUCING AGENT

(54)発明の名称 睡眠誘発剤

(57) Abstract

A sleep inducing agent comprising, as an active component, a prostaglandin derivative represented by formula (1), wherein X represents a halogen atom, Y represents a group represented by $(CH_2)_m$, a cis-vinylene group or a phenylene group, Z represents an ethylene group, a trans-vinylene group, OCH_2 or $Si(O)_2CH_2$, R¹ is a C_{1-10} cycloalkyl group, a C_{1-10} cycloalkyl group substituted with a C_{1-10} alkyl group, a C_{1-10} cycloalkylalkyl group, a C_{1-10} alkyl group, a C_{1-10}

スコア	0: 0 - 60 秒A
SCORE	1: 60 - 225 秒A
	2: 225 - 450 秒A
	3: 450 - 675 秒A
	4: 675 - 800 秒A

B —○— 試験方法
C —●— 化合物 1: 1 μg/monkey, i.c.
C —▲— 化合物 2: 10 μg/monkey, i.c.

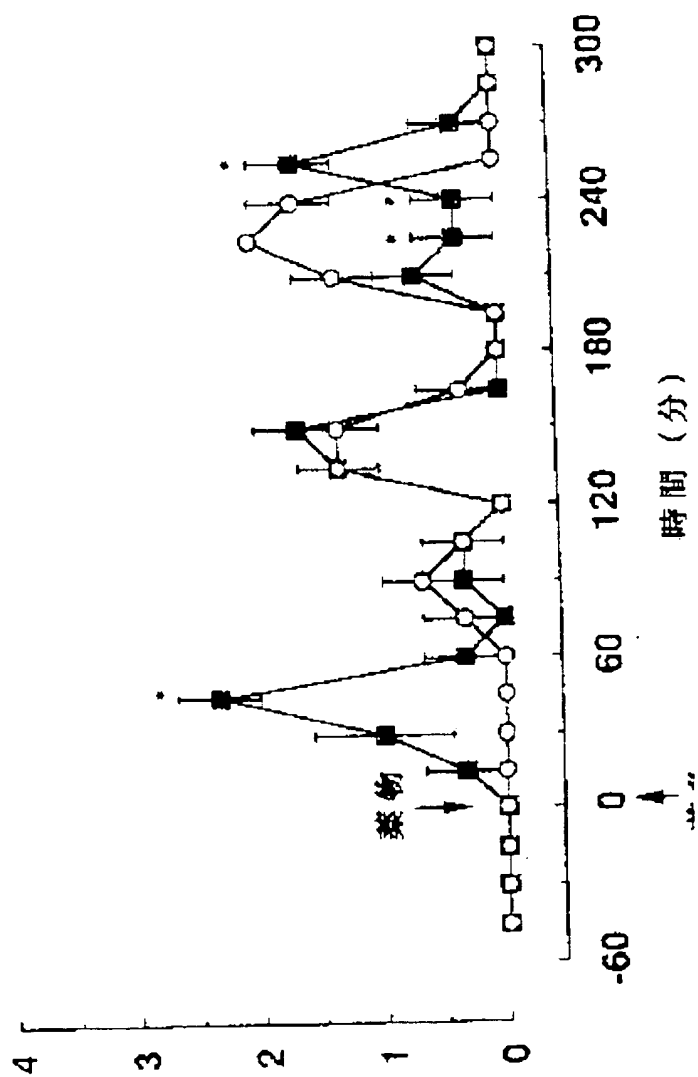
* : p < 0.1



2 / 2

0: 0 - 60 秒
1: 60 - 225 秒
2: 225 - 450 秒
3: 450 - 675 秒
4: 675 - 900 秒

—○— 溶媒投与群
—■— PG D₂ 10 μg/monkey, i.c.
*: p < 0.05 (対 溶媒投与群)



1 / 2

スコア	0: 0 - 60 秒
	1: 60 - 225 秒
	2: 225 - 450 秒
	3: 450 - 675 秒
	4: 675 - 900 秒

* : $p < 0.05$ (対 溶媒投与群)

—○— 溶媒投与群

---■--- 化合物 32 1 $\mu\text{g}/\text{monkey, i.c.}$

—▲— 化合物 32 10 $\mu\text{g}/\text{monkey, i.c.}$

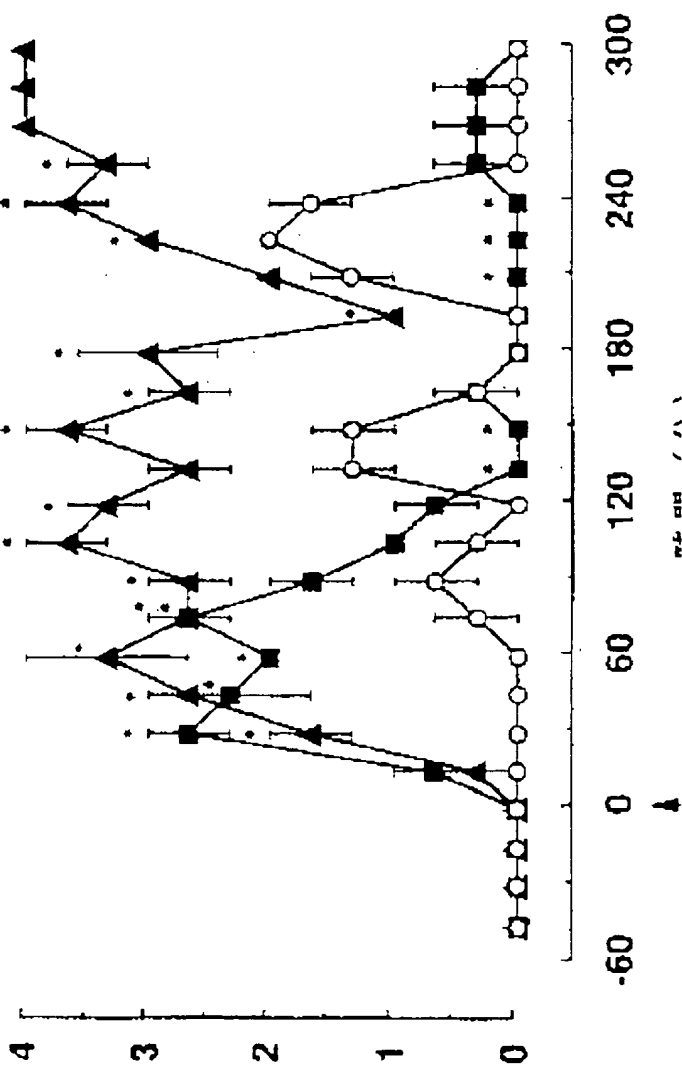


表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 71	β -Cl	CH_2CH_2	$\text{CH}=\text{CH}$	シクロヘキシル	水素
化合物 72	β -Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CH}=\text{CH}$	シクロヘキシル	水素

WO 99/61029

PC

8

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 45	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SOCH ₃	2, 6-ジメチル-5-ヘプタニル	水素
化合物 46	β -Cl	o-インターフェニル	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 47	β -Cl	m-インターフェニル	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 48	β -Cl	p-インターフェニル	OCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 49	β -Cl	o-インターフェニル	SOCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 50	β -Cl	m-インターフェニル	SOCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 51	β -Cl	p-インターフェニル	SOCH ₃	シクロヘキシル	水素
化合物 52	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 53	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 54	β -Cl	CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 55	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 56	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 57	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 58	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 59	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシルメチル	メチル
化合物 60	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 61	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2-メチル-1-ヘキシル	メチル
化合物 62	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2-メチル-1-ヘキシル	水素
化合物 63	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2, 6-ジメチル-5-ヘプタニル	メチル
化合物 64	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	2, 6-ジメチル-5-ヘプタニル	水素
化合物 65	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	1-メチル-3-ヘキシル	メチル
化合物 66	β -Cl	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	1-メチル-3-ヘキシル	水素

WO 99/61029

PC

8

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 45	β -Cl	CH_2CH_2	SCH_2	2,6-ジメチル-5-アジリル	水素
化合物 46	β -Cl	6-ベンゾフルレン	OCH_2	シクロヘキシル	水素

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 19	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 20	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 21	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 22	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 23	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 24	β -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 25	α -Cl	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 26	β -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 27	α -Br	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 28	F	CH ₂ CH ₂	OCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 29	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	tert-ブチル
化合物 30	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 31	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	メチル
化合物 32	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 33	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 34	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 35	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 36	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 37	β -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシルメチル	水素
化合物 38	α -Cl	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 39	β -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素
化合物 40	α -Br	CH ₂ CH ₂	SCH ₂	シクロヘキシル	水素

表 1 のつづき

	X	Y	Z	R ¹	R ²
化合物 19	β -Cl	CH_2CH_2	OCH_2	シクロヘキシル	水素
化合物 20	β -Cl	CH_2CH_2	OCH_2	シクロヘキシル	水素